


VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055192/Nl	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014328	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 16.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 18.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04, A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 7 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 6 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 17.10.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 02.02.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Guspanova, J Tel. +49 89 2399-7834	



INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014328

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt*):

Beschreibung, Seiten

1-62 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-11 eingegangen am 17.12.2005 mit Schreiben vom 16.12.2005

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014328

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|---------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-11 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-11 |
| | Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-11 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)
- und / oder
2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

siehe Beiblatt

Zu Punkt II

Priorität

Das Dokument D6, das am 21. Mai 2004 veröffentlicht wurde, wird in diesem Bescheid nicht berücksichtigt. Es kann jedoch nach dem Eintritt in die europäische Phase für die Beurteilung von Neuheit der vorliegenden Anmeldung relevant sein.

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Relevante Dokumente

In diesem Bescheid werden folgende, im Recherchenbericht zitierte Dokumente **D1- D6** genannt; die Numerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

- D1: WO 02/50077 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; GEBAUER, OLAF; ELBE, HANS-LUDWIG; HENRICH, M) 27. Juni 2002 (2002-06-27)
- D2: WO 03/091254 A (BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; GEBAUER, OLAF; GREUL, NICO, JOER) 6. November 2003 (2003-11-06)
- D3: EP-A-0 550 113 (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07)
- D4: WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16. Januar 2003 (2003-01-16)
- D5: WO 03/080615 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 2. Oktober 2003 (2003-10-02)
- D6: WO 2004/041824 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; BLETTNER, CARSTEN; MUE) 21. Mai 2004 (2004-05-21)

2. Änderungen

Der Anmelder hat einen geänderten Anspruchssatz eingereicht. Alle eingereichten Änderungen bringen keine Sachverhalte ein, die im Widerspruch zu Artikel 19(2) PCT über den Offenbarungsgehalt der Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgehen würden.

3. Neuheit

Mit der Streichung der Bedeutung "Halogenalkyl" aus dem Umfang der Gruppen L^1 - L^3 wurde die Neuheit der vorliegenden Anmeldung wiedererstellt.

Die vorliegende Anmeldung betrifft 7-Amino-6-(2-halophenyl)-triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I (Ansprüche 1-5), Verfahren zu ihrer Herstellung (Ansprüche 6 und 7), Zwischenprodukte (Anspruch 8), Verwendung von Verbindungen der Formel I zur Bekämpfung von Schadpilzen (Anspruch 9), Saatgut enthaltend diese Verbindungen (Anspruch 10) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen (Anspruch 11).

Das Dokument D1 offenbart eine breite Familie von Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I) (Anspruch 1), die fungizide Wirkung aufweisen (Seite 4, Absatz 1). Die Definitionen der Substituenten in der allgemeinen Formel (I) aus D1 überlappen sich zwar mit den Definitionen der Substituenten der vorliegenden Formel I, das Überlappungsgebiet ist jedoch nicht explizit durch die Beispiele gestützt. Die Verbindungen der Beispiele aus dem Dokument D1 weisen im Vergleich zu den vorliegenden Verbindungen ein anderes Substitutionsmuster sowohl der 7-Amino-Gruppe als auch der Phenylgruppe auf. Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1-11 ist somit als neu gegenüber D1 angesehen.

Das Dokument D2 offenbart eine breite Familie von Triazolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I) (Anspruch 1), die fungizide Wirkung aufweisen (Seite 13, Absatz 1). Die Definitionen der Substituenten in der allgemeinen Formel (I) aus D2 überlappen sich zwar mit den Definitionen der Substituenten der vorliegenden Formel I, das Überlappungsgebiet ist jedoch nicht explizit durch die Beispiele gestützt. Die Verbindungen der Beispiele aus dem Dokument D2 weisen im Vergleich zu den vorliegenden Verbindungen ein anderes Substitutionsmuster sowohl der 7-Amino-Gruppe als auch der Phenylgruppe auf. Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche 1-11 ist somit als neu gegenüber D2 angesehen.

Die Dokumente D3 und D4 offenbaren u.a. 7-Amino-6-(substituiertes)-Phenyl-triazolopyrimidine, die jeweils durch eine allgemeine Formel definiert sind. Alle diese Verbindungen werden zur Bekämpfung von Schadpilzen verwendet.

Der einzige Unterschied zwischen den offenbarten Verbindungen aus dem Stand der Technik D3/D4 und den vorliegenden Verbindungen liegt im Charakter des Substitutionsmuster am Phenylring. Das essentielle technische Merkmal der vorliegenden Verbindungen, nämlich ein Halogenatom in ortho-Position und ein weiteres Substituent L^1/L^2 (definiert im vorliegenden Anspruch 1) in meta-Position am Phenylring, ist in den Verbindungen der Dokumente D3 und D4 nicht vorhanden. Der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber dem Stand der Technik D3 und D4 neu.

Das Dokument D5 offenbart Triazolopyrimidine der allgemeiner Formel (I), die sich von der vorliegenden Formel dadurch unterscheidet, das sie keine Aminogruppe in der Stellung 7 des Triazolopyrimidin-Grundgerüsts trägt, sondern lediglich Kohlenwasserstoffresten (siehe Definition für den Substituenten R^1). Die Verbindungen des Dokumenten D5 werden zur Bekämpfung von Schadpilzen verwendet. Der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist gegenüber dem Stand der Technik D5 neu.

Zusammengefaßt, die vorliegenden Ansprüche 1-11 sind als neu gegenüber dem Stand der Technik angesehen, gemäß Artikel 33(2) PCT.

4. Erfinderische Tätigkeit

Die der Erfindung zugrundeliegende Aufgabe war es, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Das Dokument D1 oder D2 können als nächstliegender Stand der Technik angesehen werden. Diese Dokumente offenbaren Verbindungen, die sich von den vorliegenden Verbindungen strukturell lediglich im Substitutionsmuster 6-Phenyl-Gruppe unterscheiden. Die bevorzugten Verbindungen aus D1/D2 tragen zwei Substituenten auf der Aminogruppe in der Stellung 7 und ein anderes Substitutionsmuster der 6-Phenyl-Gruppe als die vorliegenden Verbindungen.

Die Lösung der obengenannten Aufgabe beruht in der Herstellung von Verbindungen, die durch allgemeine Formel I.1 im Anspruch 3 definiert sind. Die Daten sind auf den Seiten 61, Zeilen 26-31 und auf der Seite 62, Zeilen 4-7 gegeben. Die Vergleichsdaten wurden mit dem Schreiben vom 16.12.2005 nachgereicht.

Die im Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagene Lösung kann aus folgenden Gründen als erfinderisch betrachtet werden (Artikel 33(3) PCT):
Ausgegangen von D1/D2-Verbindungen, der Fachmann hätte das Substitutionsmuster der 6-Phenyl-Gruppe ändern müssen, um zu den vorliegenden Verbindungen zu gelangen. Dokumente D1 und D2 schlagen verschiedene Modifizierungen vor (siehe die Substituenten R³ in D1 und R in D2). Diese ist für den Fachmann als eine übliche Vorgehensweise angesehen. Der Fachmann würde versuchen weitere Substituenten (bekannt aus D1 und D2) an die 6-Phenyl-Gruppe der Verbindungen aus D1/D2 einzuführen, wobei er die gleiche oder ähnliche Wirkung bei solchen neuen Derivaten erwarten würde. Der Fachmann würde wahrscheinlich bei einer solchen Modifikation keine erhebliche Wirkungsänderung erwarten. Deswegen die vorliegenden Verbindungen mit einer erhöhten Aktivität (gemäß nachgereichten Vergleichsdaten) werden als nicht naheliegend angesehen.

Somit wird der ganze Gegenstand der vorliegenden Anmeldung als erfinderisch angesehen, gemäß Artikel 33(3) PCT.

Zu Punkt VI

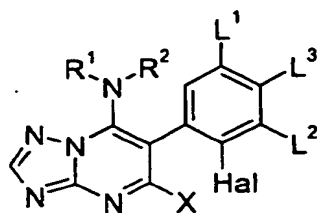
Bestimmte angeführte Unterlagen

Bestimmte veröffentlichte Unterlagen

Anmelde Nr. Patent Nr.	Veröffentlichungsdatum (Tag/Monat/Jahr)	Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (zu Recht beansprucht) (Tag/Monat/Jahr)
WO 04/041824	21.05.2004	04.11.2003	07.11.2002

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R^1 , R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Halogencycloalkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_2 - C_8 -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15 R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, 20 C_3 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkenyloxy, C_1 - C_6 -Alkylen und Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy tragen kann;

25 R^1 und/oder R^2 können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

30 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy carbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_2 - C_6 -Halogenalkynyl, C_3 - C_6 -Alkynyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkynyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkenoxy, C_1 - C_3 -Oxyalkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

35

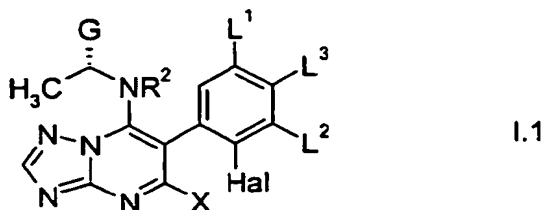
wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

- 5 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- 10
- 15 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:
- 20 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- C_1 - C_6 -alkoxy, Aryl- C_1 - C_6 -alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können;
- 25
- Hal Halogen;
- 30 L^1 , L^2 Wasserstoff, Cyano, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_3 - C_6 -Alkenyloxy oder $C(=O)A$, wobei mindestens eine Gruppe L^1 oder L^2 ungleich Wasserstoff ist;
- A Wasserstoff, Hydroxy, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_8 -Alkylamino oder Di- $(C_1$ - C_8 -Alkyl)amino;
- 35 L^3 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl;
- X Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy.
- 40 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der R^1 nicht Wasserstoff bedeutet.

65

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei R² Wasserstoff, Methyl oder Ethyl bedeutet.
4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.1 entsprechen,

5

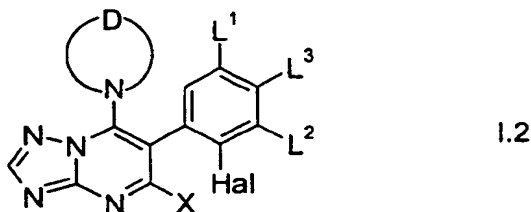


in der

G C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxymethyl, oder C₃-C₆-Cycloalkyl;R² Wasserstoff oder Methyl; undX Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und L¹ bis L³ und Hal gemäß Anspruch 1 definiert sind.

10

5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, welche der Formel I.2 entsprechen,



15

in der

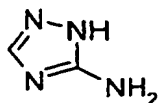
D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann;

20

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und L¹ bis L³ und Hal gemäß Anspruch 1 definiert sind.

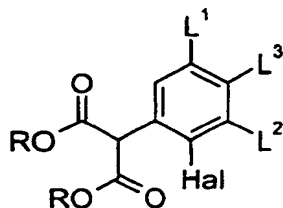
25

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



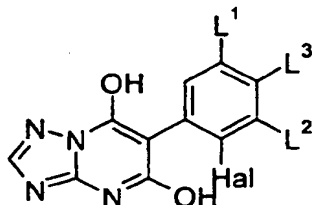
mit Phenymalonaten der Formel III,

66



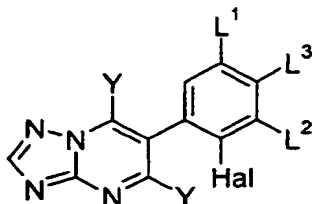
III

in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,



IV

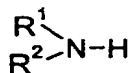
Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



V

5

in der Y für Halogen steht und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



VI

10

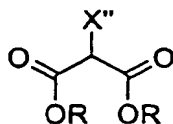
zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,

M-X'

VII

15

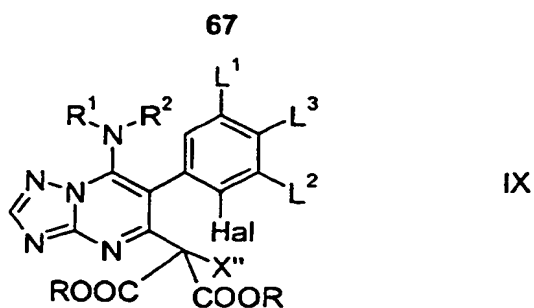
die, je nach der einzuführenden Gruppe X', ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und, gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,



VIII

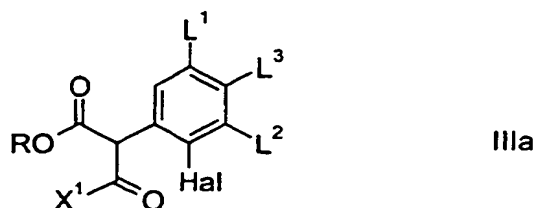
20

in der X'' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX

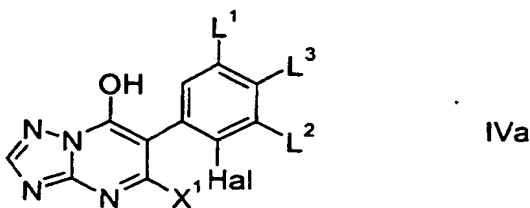


und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

- 5 7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 5 mit Ketoestern der Formel IIIa,

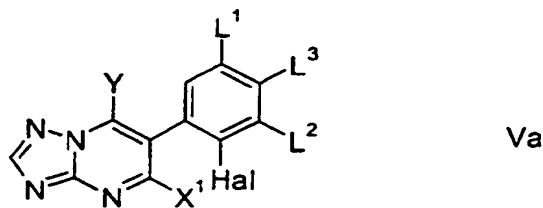


in der X¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl und R für C₁-C₄-Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriaxolopyrimidinen der Formel IVa,



10

Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriaxolopyrimidinen der Formel Va,



in der Y für Halogen steht und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 5 zu Verbindungen I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht.

15

8. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 6 und 7.

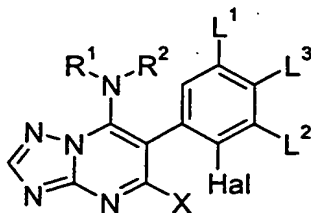
- 20 9. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

68

10. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.
- 5 11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



in which the substituents are as defined below:

R¹, R² independently of one another are hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a five- or six-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₃-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, C₁-C₆-alkylene and oxy-C₁-C₃-alkyleneoxy;

R¹ and/or R² may carry one to four identical or different groups R^a:

R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-alkynyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkoxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, C₁-C₃-oxyalkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a five- to ten-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups R^b:

5 R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyloxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxy carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothio-
10 carbonyl, where the alkyl groups in these radicals contain 1 to 6 carbon atoms and the abovementioned alkenyl or alkynyl groups in these radicals contain 2 to 8 carbon atoms;

15 and/or one to three of the following radicals:

cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclyloxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C₁-C₆-alkoxy, aryl-C₁-C₆-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to
20 10 ring members and the hetaryl radicals 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

25 Hal is halogen;

L¹, L² are hydrogen, cyano, C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-alkenyloxy or C(=O)A, where at least one group L¹ or L² is not hydrogen;

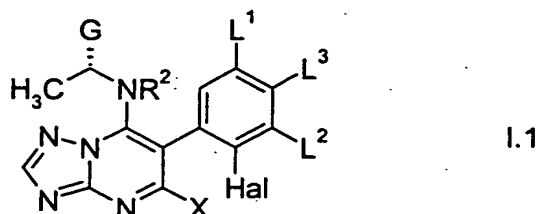
30 A is hydrogen, hydroxy, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₈-alkylamino or di-(C₁-C₈-alkyl)amino;

L³ is hydrogen, halogen, cyano, nitro, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl;

35 X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy.

2. The compound of the formula I according to claim 1 in which R¹ is not hydrogen.
- 40 3. The compound of the formula I according to claim 1 or 2, where R² is hydrogen, methyl or ethyl.

4. The compound of the formula I according to claim 1, which corresponds to the formula I.1



in which

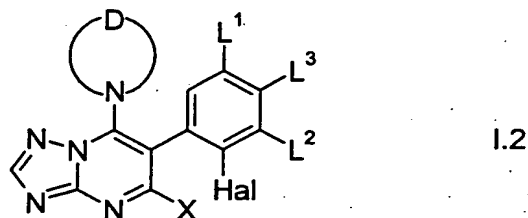
G is C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkoxymethyl or C₃-C₆-cycloalkyl;

R² is hydrogen or methyl; and

X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy and

L¹ to L³ and Hal are as defined according to claim 1.

5. The compound of the formula I according to claim 1 which corresponds to the formula I.2



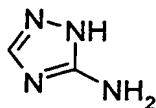
in which

D together with the nitrogen atom forms a five- or six-membered heterocyclyl or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy and C₁-C₂-haloalkyl;

X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy and

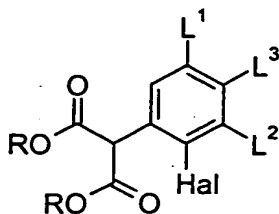
L¹ to L³ and Hal are as defined according to claim 1.

6. A process for preparing the compounds of the formula I according to claim 1 in which X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy, by reacting 5-aminotriazole of the formula II



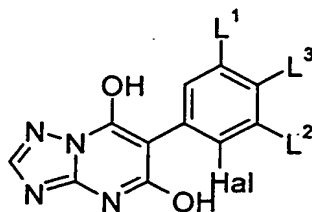
66

with phenylmalonates of the formula III,



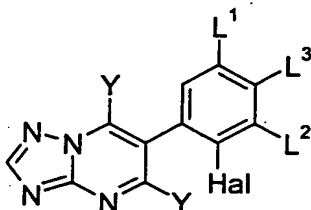
III

5 in which R is alkyl, to give dihydroxytriazolopyrimidines of the formula IV,



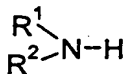
IV

halogenation to give the dihalo compounds of the formula V,



V

10 in which Y is halogen and reaction of V with amines of the formula VI



VI

15 to give compounds of the formula I in which X is halogen, if desired, to prepare compounds of the formula I in which X is cyano, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy, reaction of compounds I in which X is halogen with compounds of the
20 formula VII

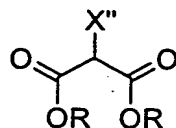
M-X'

VII

25 which, depending on the group X' to be introduced, are inorganic cyanides, alkoxides or haloalkoxides and in which M is an ammonium, tetraalkylammonium, alkali metal or alkaline earth metal cation, and, if desired, to prepare compounds of the formula I according to claim 1 in which X is alkyl, by reaction of the

67

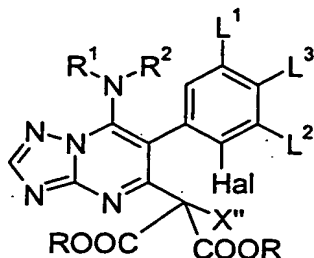
compounds of the formula I in which X is halogen with malonates of the formula VIII



VIII

5

in which X'' is hydrogen or C₁-C₃-alkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give compounds of the formula IX



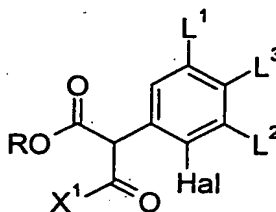
IX

10

and decarboxylation to give compounds I in which X is alkyl.

7. A process for preparing the compounds of the formula I according to claim 1 in which X is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl by reacting 5-aminotriazole of the formula II according to claim 5 with keto esters of the formula IIIa

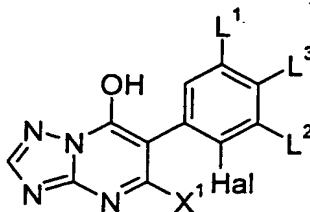
15



IIIa

20

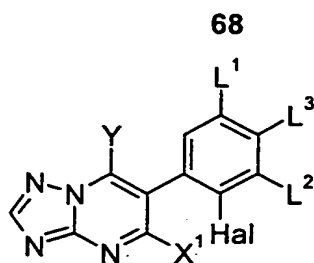
in which X¹ is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give 5-alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines of the formula IVa,



IVa

halogenation of IVa to give 7-halotriazolopyrimidines of the formula Va

25



Va

in which Y is halogen and reaction of Va with amines of the formula VI according to claim 5 to give compounds I in which X is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl.

5

8. The compound of the formula IV, IVa, V or Va according to claims 6 and 7.

9. A fungicidal composition, comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to claim 1.

10

10. Seed, comprising 1 to 1000 g of a compound of the formula I according to claim 1 per 100 kg.

15

11. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or seeds to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I according to claim 1.